

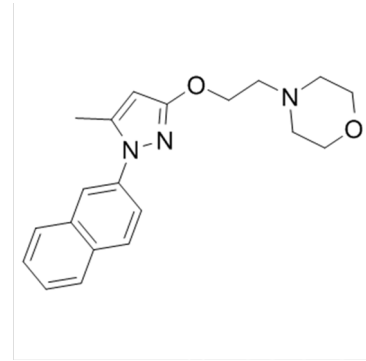
## S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2393-10mM	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2393-5mg	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	5mg
SD2393-25mg	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-[2-(5-methyl-1-naphthalen-2-yl)pyrazol-3-yl]oxyethyl]morpholine
简称	S1RA
别名	E-52862, E52862, E 52862
中文名	N/A
化学式	C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>
分子量	337.42
CAS号	878141-96-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 40mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.48ml DMSO, 或每3.37mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD2393-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	S1RA (E-52862) is a potent and selective sigma-1 receptor ( $\sigma$ 1R, $K_i=17nM$ ) antagonist, showed good selectivity against $\sigma$ 2R ( $K_i>1000nM$ ).				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	$\sigma$ 1R	$\sigma$ 2R	—	—	—
IC50	17nM ( $K_i$ )	>1000nM ( $K_i$ )	—	—	—
体外研究	S1RA behaved as a highly selective $\sigma$ 1 receptor antagonist. It showed high affinity for human ( $K_i=17nM$ ) and guinea pig ( $K_i=23.5nM$ ) $\sigma$ 1 receptors but no significant affinity for the $\sigma$ 2 receptors ( $K_i>1000nM$ for guinea pig and rat $\sigma$ 2 receptors). Moderate affinity ( $K_i=328nM$ ) and antagonistic activity, with very low potency ( $IC_{50}=4700nM$ ) was found at the human 5-HT <sub>2B</sub> receptor. S1RA showed no significant affinity ( $K_i>1\mu M$ or % inhibition at $1\mu M <50%$ ) for other additional 170 targets (receptors, transporters, ion channels and enzymes).				
体内研究	Control (non-operated) and nerve-injured mice received a single or repeated (twice daily for 12 days) i.p. administration of S1RA at 25mg/kg/L, the same dose used for the assessment of behavioural hypersensitivity in the chronic treatment study. Acute treatment was given on day 12 post-surgery and repeated treatment with S1RA started the day of surgery, as in the behavioural studies. Intrathecal pre-treatment with idazoxan prevented the systemic S1RA antinociceptive effect, suggesting that the S1RA antinociception depends on the activation of spinal $\alpha$ 2 -adrenoceptors which, in turn, could induce an inhibition of formalin-evoked glutamate release. When administered locally, intrathecal S1RA inhibited only the flinching behavior, whereas intracerebroventricularly or intraplantarly injected also attenuated the lifting/licking behavior.				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A

处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Díaz JL, et al. J Med Chem. 2012 Oct 11, 55(19), 8211-24.
2. Romero L, et al. Br J Pharmacol. 2012 Aug, 166(8), 2289-306.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD2393-10mM	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2393-5mg	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	5mg
SD2393-25mg	S1RA (Sigma Receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制成高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01